

(57) **Abstract:** The invention relates to new C-19-halogen-substituted steroids of the androst-9(11)-ene series, namely 17 $\beta$ -hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-dien-3-ones of general formula (I) and process for their production. In addition, the use of new radiohalogen-labeled compounds of Formula (I) as radiopharmaceutical agents is the subject of the invention as well as the use of non-labeled compounds of Formula (I) as starting products for the production of new biologically active 5 $\beta$ -substituted androst-9(11)-enes of general formula (II) and the new 6 $\beta$ ,19-cycloandrostanadienes of Formula (III) as well as processes for their production and their use.

## (12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
25. Januar 2001 (25.01.2001)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 01/05805 A3**(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07J 1/00, A61K 31/565, G01N 33/60, C07J 51/00, 53/00, 21/00, 71/00, 43/00, A61P 5/36, 5/32

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/DE00/02390

(22) Internationales Anmeldedatum:  
17. Juli 2000 (17.07.2000)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
199 34 088.9 15. Juli 1999 (15.07.1999) DE(71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstrasse 178, D-13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): NEEF, Günter [DE/DE]; Markgraf-Albrecht-Strasse 4, D-10711 Berlin (DE). GOLDE, Roland [DE/DE]; Schönfliesser Strasse 24, D-16562 Bergfelde (DE). FRITZEMEIER, Karl-Heinrich [DE/DE]; Rabenstrasse 5a, D-13505 Berlin (DE).(81) Bestimmungsstaaten (*national*): AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

## Veröffentlicht:

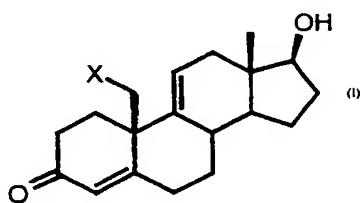
— mit internationalem Recherchenbericht

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen  
Recherchenberichts: 13. September 2001

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: NOVEL C-19-HALOGEN-SUBSTITUTED, 5-SUBSTITUTED, 5-SUBSTITUTED OR 6,10 CARBOCYCLICALLY CONDENSED STEROIDS OF THE ANDROST-9(11)-ENE-SERIES, METHODS FOR THE PRODUCTION AND USE THEREOF

(54) Bezeichnung: NEUE C-19-HALOGENSUBSTITUIERTE, 5-SUBSTITUIERTE, 5-SUBSTITUIERTE ODER 6,10-CARBOZYKLISCH-KONDENSIERTE STEROIDE DER ANDROST-9(11)-EN-REIHE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG SO- WIE IHRE VERWENDUNG



## (57) Abstract:

The invention relates to novel C-19-halogen-substituted steroids of the androst-9(11)-ene series, i.e. 17 $\beta$ -hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-diene-3-one of general formula (I) and to methods for the production thereof. The invention also relates to the use of novel radiohalogen-marked compounds of formula 1 as radiopharmaceuticals. The invention further relates to non-marked compounds(I) of formula I as initial products for the production of novel biologically effective 5 $\beta$ -substituted Androst-9(11)-enes of general formula (II) and novel 6 $\beta$  19-cycloandrostanediens of formula (III), in addition to methods and uses thereof.

WO 01/05805 A3

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft neue C-19-halogensubstituierte Steroide der Androst-9(11)-en-Reihe, nämlich 17 $\beta$ -Hydroxy-19-halogen-androsta-4,9(11)-dien-3-one der allgemeinen Formel (I), und Verfahren zu ihrer Herstellung. Des weiteren ist die Verwendung der neuen radiohalogen-markierten Verbindungen der Formel (I), als Radiopharmaka Gegenstand der Erfindung sowie die Verwendung der nichtmarkierten Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsprodukte zur Herstellung von neuen biologisch wirksamen 5 $\beta$ -substituierten Androst-9(11)-enen der allgemeinen Formel (II) und der neuen 6 $\beta$ , 19-Cycloandrostanediene der Formel (III) sowie Verfahren zu deren Herstellung und ihre Verwendung.